(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

- (19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro
- AIPO OMPI

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 5. Juni 2003 (05.06.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 03/045957 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 513/04, 307/60, 493/10, 495/10, 207/42, 277/34, A01N 43/08, 43/10, 43/36
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/12881
- (22) Internationales Anmeldedatum:

18. November 2002 (18.11.2002)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

- (30) Angaben zur Priorität: 101 58 560.8 29. November 2001 (29.11.2001) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGE-SELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): FISCHER, Reiner [DE/DE]; Nelly-Sachs-Str. 23, 40789 Monheim (DE). ULLMANN, Astrid [DE/DE]; Merowingerstr. 31, 50677 Köln (DE). BRETSCHNEIDER, Thomas [DE/DE]; Talstr. 29b, 53797 Lohmar (DE). DREWES, Mark, Wilhelm [DE/DE]; Goethestr. 38, 40764 Langenfeld (DE). ERDELEN, Christoph [DE/DE]; Unterbüscherhof 15, 42799 Leichlingen (DE). FEUCHT, Dieter [DE/DE]; Ackerweg 9, 40789 Monheim (DE). RECKMANN, Udo [DE/DE]; Röntgenstr. 18, 50823 Köln (DE). KUCK, Karl-Heinz [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30a, 40764 Langenfeld (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE).

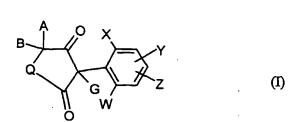
- (74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; Legal and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

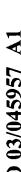
— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

- (54) Title: 3-BIPHENYL-SUBSTITUTED-3-SUBSTITUTED-4-KETOLACTAM AND KETOLACTONE AND THEIR UTILIZATION AS PESTICIDE
- (54) Bezeichnung: 3-BIPHENYLSUBSTITUIERTE-3-SUBSTITUIERTE-4-KETOLAKTAME UND -LAKTONE UND DEREN ANWENDUNG ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL



- (57) Abstract: The invention relates to novel 3-biphenyl-substituted-3-substituted-4-ketolactam and ketolactone of formula (I), wherein A, B, Q, G, W, X, Y and Z have the above-mentioned meaning. The invention also relates to a method for the production of said compounds and to the utilization thereof as pesticide and/or microbicide and/or herbicide.
- (57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft neue 3-Biphenylsubstituierte-3-substituierte-4-ketolaktame und -laktone der Formel (I), in welcher A, B, Q, G, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel und/oder Mikrobizide und/oder Herbizide.





BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG) hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Prior-

hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht

3-BIPHENYLSUBSTITUIERTE-3-SUBSTITUIERTE-4-KETOLAKTAME UND -LAKTONE UND DEREN
ANWENDUNG ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

Die Erfindung betrifft neue 3-Biphenylsubstituierte-3-substituierte-4-ketolaktame und -laktone, Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel, Mikrobizide und/oder Herbizide.

Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte phenylsubstituierte 3-Halogen-4-ketolaktame (JP-A-10-258 555) und phenylsubstituierte 3-Halogen-4-ketolaktone (JP-A-10-258 555) als Akarizide, Insektizide und/oder Herbizide wirksam sind.

Die Wirksamkeit und Wirkungsbreite dieser Verbindungen ist jedoch insbesondere bei niedrigen Aufwandmengen und Konzentrationen nicht immer völlig zufriedenstellend. Weiterhin ist die Pflanzenverträglichkeit dieser Verbindungen in den Kulturpflanzen nicht immer ausreichend.

Es wurden nun neue Verbindungen der Formel (I) gefunden,

$$\begin{array}{c|c}
A & O & X \\
\hline
G & X \\
\hline
Z
\end{array}$$
(I)

20 in welcher

5

10

15

- Q für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppe N-D steht,
- X für Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfinyl, Alkylsulfinyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Nitro, Cyano oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,
 - Y für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Hetaryl steht,

- W und Z unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano stehen,
- für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, 5 Α Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls mindestens ein Ringatom durch ein Heteroatom ersetzt ist, oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht, 10
 - В für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, oder
- A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten, gegebenenfalls mindestens ein Heteroatom 15 enthaltenden unsubstituierten oder substituierten Cyclus stehen,
 - für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe D Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eines oder mehrere Ringglieder durch Heteroatome ersetzt sind, Arylalkyl, Aryl, Hetarylalkyl oder Hetaryl steht oder
- A und D gemeinsam mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen gesättigten 25 oder ungesättigten und gegebenenfalls mindestens ein Heteroatom enthaltenden, im A.D-Teil unsubstituierten oder substituierten Ring stehen,
 - G für Halogen oder Nitro steht.

30 Die Verbindungen der Formel (I) können, auch in Abhängigkeit von der Art der Substituenten, als geometrische und/oder optische Isomere oder Isomerengemische,

10

in unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen, die gegebenenfalls in üblicher Art und Weise getrennt werden können. Sowohl die reinen Isomeren als auch die Isomerengemische, deren Herstellung und Verwendung sowie diese enthaltende Mittel sind Gegenstand der vorliegenden Erfindung. Im folgenden wird der Einfachheit halber jedoch stets von Verbindungen der Formel (I) gesprochen, obwohl sowohl die reinen Verbindungen als gegebenenfalls auch Gemische mit unterschiedlichen Anteilen an isomeren Verbindungen gemeint sind.

Unter Einbeziehung der Bedeutungen für Q ergeben sich folgende hauptsächliche Strukturen (I-1) bis (I-3):

worin

- 15 A, B, D, G, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben.
 - A) Weiterhin wurde gefunden, dass man Verbindungen der Formeln (I-1) bis (I-3) erhält

. 4 .

in welcher A, B, Q, W, X, Y und Z, die oben angegebene Bedeutung haben

5 und

G für Halogen, bevorzugt für Chlor und Brom steht,

wenn man Verbindungen der Formeln (II-1) bis (II-3)

10

in welcher A, B, Q, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben

- mit Halogenierungsmittel in Gegenwart eines Lösungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Radikalstarters umsetzt.
 - B) Weiterhin erhält man Verbindungen der Formeln (I-1) bis (I-3)

- 5 -

in welcher A, B, Q, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben

und

5

15

G für Nitro steht,

wenn man Verbindungen der Formeln (II-1) bis (II-3)

10 in welcher

A, B, Q, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben

mit Nitrierungsreagenzien wie z.B. rauchende Salpetersäure in Gegenwart eines Lösungsmittels umsetzt.

Die für die Verfahren A und B benötigten Verbindungen der Formeln (II-1) bis (II-3)

20 in welcher

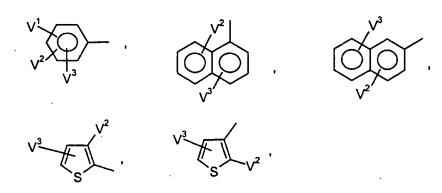
A, B, Q, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben, sind bekannte Verbindungen (WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673) oder lassen sich nach den dort beschriebenen Verfahren synthetisieren.

Als Halogenierungsmittel kommen für das Verfahren A beispielsweise Sulfurylchlorid, Sulfurylbromid, Thionylchlorid, Thionylbromid, Imide wie z.B. N-Bromsuccinimid oder N-Chlorsuccinimid, Chlorsulfonsäure aber auch Hypochlorite wie z.B. tert.-Butylhypochlorit in Frage.

Als Nitrierungsreagenzien kommen für das Verfahren B rauchende Salpetersäure aber auch "Nitriersäuremischungen" in Frage.

- Weiterhin wurde gefunden, dass die neuen Verbindungen der Formel (I) eine sehr gute Wirksamkeit als Schädlingsbekämpfungsmittel, vorzugsweise als Insektizide, Akarizide und/oder Fungizide und/oder Herbizide aufweisen.
- Die erfindungsgemäßen Verbindungen sind durch die Formel (I) allgemein definiert.

 Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in der oben und nachstehend erwähnten
 Formeln aufgeführten Reste werden im folgenden erläutert:
 - Q steht bevorzugt für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppe N-D,
- 20 W steht bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy,
- X steht bevorzugt für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl,
 - Y steht bevorzugt für einen der Reste



- 7 -

V¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro, Cyano oder gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl,

5

10

V² und V³ stehen bevorzugt unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy,

Z steht bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano,

steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁
C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy
C₁-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl, gegebenenfalls durch Halogen,

C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl oder für Wasserstoff, wenn im Falle der Gruppe (I-1) D ungleich Wasserstoff ist,

- B steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₁₂-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl oder
- A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, stehen bevorzugt für gesättigtes C₃-C₁₀-Cycloalkyl oder ungesättigtes C₅-C₁₀-Cycloalkyl, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welche gegebenenfalls einfach oder zweifach durch C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, Halogen oder Phenyl substituiert sind oder

10

5

A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen bevorzugt für C₃-C₆-Cycloalkyl, welches durch eine gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthaltende Alkylendiyl-, oder durch eine Alkylendioxyl- oder durch eine Alkylendithioyl-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- bis achtgliedrigen Ring bildet oder

15

20

A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, stehen bevorzugt für C₃-C₈-Cycloalkyl oder C₅-C₈-Cycloalkenyl, in welchen zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder Halogen substituiertes C₂-C₆-Alkandiyl, C₂-C₆-Alkendiyl oder C₄-C₆-Alkandiendiyl stehen, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist.

25

30

D steht bevorzugt für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder gegebenenfalls

durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl,

A und D stehen gemeinsam bevorzugt für jeweils gegebenenfalls substituiertes C3-C6-Alkandiyl oder C3-C6-Alkendiyl, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und wobei als Substituenten jeweils in Frage kommen:

C1-C6-Alkyl, C1-C6-Alkoxy oder eine weitere C3-C6-Alkandiylgruppierung,

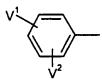
10

G steht bevorzugt für Chlor, Brom oder Nitro.

In den als bevorzugt genannten Restedefinitionen steht Halogen für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

15

- Q steht besonders bevorzugt für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppe N-D,
- W steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl,
- 20 X steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alk-oxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder Cyano,
 - Y steht besonders bevorzugt für den Rest



25

V¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano, gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-

C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl,

- v² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl,
 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy,
 - Z steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkoxy,
- 10 A steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis fünffach durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder jeweils gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder für Wasserstoff, wenn im Falle der Gruppe (I-1) D ungleich Wasserstoff ist,
- 20 B steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl oder
 - A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, stehen besonders bevorzugt für gesättigtes C₃-C₈-Cycloalkyl, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach bis zweifach durch C₁-C₆-Alkyl, C₅-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₃-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, Fluor, Chlor oder Phenyl substituiert ist, mit der Maßgabe, dass D in der Gruppe (I-1) für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht,
- D steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls einfach
 30 bis fünffach durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl oder C₁-C₄-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, für

10

20

25

gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl, oder

A und D stehen gemeinsam besonders bevorzugt für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₅-Alkandiyl, in welchem eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt sein kann, wobei als Substituenten C₁-C₄-Alkyl in Frage kommen,

- G steht besonders bevorzugt für Chlor, Brom oder Nitro.
- In den als besonders bevorzugt genannten Restedefinitionen steht Halogen für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.
 - Q steht ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppe N-D,
 - W steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Methyl oder Ethyl,
 - X steht ganz besonders bevorzugt für Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy oder Cyano,
 - Y steht ganz besonders bevorzugt für den Rest

PCT/EP02/12881

- 12 -

- V1 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro oder Cyano,
- V² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy,
- Z steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl,

 n-Propyl oder Methoxy,
 - A steht ganz besonders bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₂-Alkoxy-C₁-C₂alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch
 Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für Wasserstoff, wenn im Falle der
 Gruppe (I-1) D ungleich Wasserstoff ist,
 - B steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder
- A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, stehen ganz besonders

 bevorzugt für gesättigtes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein

 Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, tert.
 Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, n-Butoxy oder iso-Butoxy substituiert ist, mit der Maßgabe, dass D in der Gruppe (I-1)

 für Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl insbesondere aber für Wasserstoff steht,
 - D steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, insbesondere bevorzugt für Wasserstoff,

WO 03/045957

5

15

- A, D stehen gemeinsam ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₄-Alkandiyl, worin gegebenenfalls ein Kohlenstoffatom durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,
- 5 G steht ganz besonders bevorzugt für Chlor oder Nitro, insbesondere bevorzugt für Chlor.

Insbesondere bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I-1) in welcher

- 10 W insbesonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,
 - X insbesonders bevorzugt für Chlor, Methyl oder Ethyl steht,
 - Y insbesonders bevorzugt für den Rest

15

- V¹ insbesonders bevorzugt für Chlor oder Methyl steht,
- 20 V² insbesonders bevorzugt für Wasserstoff oder Chlor steht,
 - Z insbesonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl steht,
- A insbesonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, n-Butyl,

 Isobutyl, s-Butyl, tert.-Butyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht

 (hervorgehoben für Methyl oder Isopropyl steht),
 - B insbesonders bevorzugt für Methyl steht,

10

25

- A,B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, insbesonders bevorzugt für gesättigtes C₃-C₈-Cycloalkyl steht, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach durch Methyl oder im Falle von C₆-Cycloalkyl auch durch Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, n-Butoxy oder iso-Butoxy substituiert ist, (hervorgehoben für C₃-, C₅- oder C₆-Cycloalkyl, worin im Falle von C₆-Cycloalkyl gegebenenfalls ein Ringatom durch Sauerstoff ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, Methoxy oder Ethoxy substituiert ist),
 - D insbesonders beyorzugt für Wasserstoff steht,
- 15 G insbesonders bevorzugt für Chlor oder Nitro steht (hervorgehoben für Chlor steht).

Insbesonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I-2) in welcher

- 20 W insbesonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht, (hervorgehoben für Wasserstoff oder Methyl),
 - X insbesonders bevorzugt für Chlor, Methyl oder Ethyl steht, (hervorgehoben für Methyl oder Ethyl),
 - Y insbesonders bevorzugt für den Rest

(hervorgehoben für

V1 insbesonders bevorzugt für Chlor, Fluor, Cyano oder Methyl steht,

5

- V2 insbesonders bevorzugt für Wasserstoff oder Chlor steht,
- Z insbesonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl steht,
- 10 A insbesonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, s-Butyl, tert.-Butyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht, (hervorgehoben für Methyl oder Isopropyl steht),
 - B insbesonders bevorzugt für Methyl steht oder

15

20

25

A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, insbesonders bevorzugt für gesättigtes C₃-C₈-Cycloalkyl steht, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach durch Methyl oder im Falle von C₆-Cycloalkyl auch durch Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, n-Butoxy oder iso-Butoxy substituiert ist, (hervorgehoben für C₅- oder C₆-Cycloalkyl, worin im Falle von C₆-Cycloalkyl gegebenenfalls ein Ringatom durch Sauerstoff ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach durch Methyl, Trifluormethyl, Methoxy oder Ethoxy substituiert ist),

G insbesonders bevorzugt für Chlor steht.

Insbesonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I-3) in welcher

- 5 W insbesonders bevorzugt für Wasserstoff steht,
 - X insbesonders bevorzugt für Chlor oder Methyl steht, (hervorgehoben für Methyl steht),
- 10 Y insbesonders bevorzugt für den Rest

Z insbesondere bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl steht,

15

A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, insbesonders bevorzugt für gesättigtes C₅-C₆-Cycloalkyl steht, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff ersetzt ist und welches gegebenenfalls durch Methyl oder Methoxy substituiert ist, (hervorgehoben für C₆-Cycloalkyl steht),

20

25

G insbesonders bevorzugt für Chlor steht.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen bzw. Erläuterungen können untereinander, also auch zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

Erfindungsgemäß bevorzugt werden die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt (vorzugsweise) aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt werden die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

5

Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt werden die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

10

Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

15

Gegebenenfalls substituierte Reste können, sofern nichts anderes angegeben ist, einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

Im einzelnen seien außer den bei den Herstellungsbeispielen genannten Verbindungen die folgenden Verbindungen der Formel (I-1) genannt:

<u>Tabelle 1:</u> $W = H; X = CH_3, V^1 = H, V^2 = H, Z = H$

A	В	D
CH ₃	Н	Н
C ₂ H ₅	Н	H .
C ₃ H ₇	Н	H .
i-C ₃ H ₇	Н	H
C ₄ H ₉	Н	Н
i-C ₄ H ₉	Н	Н .
s-C ₄ H ₉	Н	Н
t-C ₄ H ₉	Н	Н
CH ₃	CH ₃	Н
C ₂ H ₅	CH ₃	Н
C ₃ H ₇ .	CH ₃	Н
i-C ₃ H ₇	CH ₃	Н
C ₄ H ₉	CH ₃	Н
i-C ₄ H ₉	CH ₃	Н .
s-C ₄ H ₉	CH ₃	Н .
t-C ₄ H ₉	CH ₃	Н
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Н
Δ_	CH ₃	Н
	CH ₃	Н
	CH ₃	Н
-(CH ₂) ₂ -		Н
-(CH ₂) ₄ -		H

Fortsetzung Tabelle 1:

A		В	D .	
	-(CH	12)5-	Н	
	-(CH	⁽²⁾ 6-	Н	
	-(CH	12)7-	Н	
	-(CH ₂) ₂ -(O-(CH ₂) ₂ -	Н	
	-CH ₂ -O	-(CH ₂) ₃ -	Н	
	-(CH ₂) ₂ -5	S-(CH ₂) ₂ -	Н	
	-CH ₂ -CHC	H ₃ -(CH ₂) ₃ -	Н	
	-(CH ₂)2-CH	CH ₃ -(CH ₂) ₂ -	Н	
·	-(CH ₂) ₂ -CHC	C ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	Н	
	-(CH ₂) ₂ -CHC	C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	Н	
	-(CH ₂) ₂ -CHi-	C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	Н	
	-(CH ₂) ₂ -CHC	OCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	Н	
	-(CH ₂) ₂ -CHO	C ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	Н	
	-(CH ₂) ₂ -CHO	C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	Н	
	-(CH ₂) ₂ -CHOi	-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	H	
	-(CH ₂) ₂ -C(C	H ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	Н	
	-CH ₂ -(CHCI	H ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	H .	

A	D	В	
-(CH	[2)3-	Н	
-(CH	-(CH ₂) ₄ -		
-CH ₂ -CH ₀	CH ₃ -CH ₂ -	Н	
-CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -		Н	
-CH ₂ -CHCH ₃ -CHCH ₃ -		H .	_
-СḤ ₂ -S-CH ₂ -		Н	
-CH ₂ -S-(CH ₂) ₂ -		Н	

A	D	В
	2-S-CH ₂ -	Н
CH ₂ CH CH		Н
<u></u>	-(CH ₂) ₃	
Н	CH ₃	Н
Н	C ₂ H ₅	Н
H	C ₃ H ₇	Н
Н .	i-C ₃ H ₇	Н
Н		Н
Н		н
Н		н
Н	CH ₃	CH ₃
Н	C ₂ H ₅	CH ₃
Н	C ₃ H ₇	CH ₃
Н	i-C ₃ H ₇	CH ₃
Н	Δ_	CH ₃
Н		CH ₃
Н		СН3
Н	CH ₃	C ₂ H ₅
Н	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅

Tabelle 2: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = H; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = H; V^2 = H.$$

Tabelle 3: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = CH_3; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = H; V^2 = H.$$

Tabelle 4: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = H$; $V^1 = 4$ -Cl; $V^2 = H$.

10 Tabelle 5: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = 4-Cl$; $V^2 = H$.

Tabelle 6: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = CH_3; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-Cl; V^2 = H.$$

<u>Tabelle 7:</u> A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben W = H; $X = CH_3$; Z = H; $V^1 = 3$ -C1; $V^2 = H$.

Tabelle 8: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben $W = H; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 3-Cl; V^2 = H.$

<u>Tabelle 9:</u> A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben $W = CH_3$; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = H$.

25 <u>Tabelle 10:</u> A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben W = H; $X = CH_3$; Z = H; $V^1 = 3$ -Cl; $V^2 = 4$ -Cl.

Tabelle 11: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = 4-Cl$.

Tabelle 12: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = CH_3; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 3-C1; V^2 = 4-C1.$$

Tabelle 13: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = H$; $V^1 = 4-CF_3$; $V^2 = H$.

10 Tabelle 14: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = 4-CF_3$; $V^2 = H$.

Tabelle 15: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = CH_3; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-CF_3; V^2 = H.$$

Tabelle 16: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben

$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = H$; $V^1 = 4-CH_3$; $V^2 = H$.

Tabelle 17: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben $W = H; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-CH_3; V^2 = H.$

Tabelle 18: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = CH_3; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-CH_3; V^2 = H.$$

25 <u>Tabelle 19:</u> A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben W = H; $X = CH_3$, Z = H; $V^1 = 4$ -OCH₃; $V^2 = H$.

Tabelle 20: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = 4-OCH_3$; $V^2 = H$.

15

20

Tabelle 21: A, B und D wie in Tabelle 1 angegeben $W = CH_3$; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = 4-OCH_3$; $V^2 = H$.

Im einzelnen seien außer den bei den Herstellungsbeispielen genannten Verbindungen die folgenden Verbindungen der Formel (I-2) genannt:

$$\begin{array}{c|c} A & O & X \\ \hline \\ O & CI \\ \hline \\ O & W \end{array}$$

W = H; $X = CH_3$, Z = H, $V^1 = H$, $V^2 = H$.

•
В
H
Н
Н
Н
Н
Н
Н
H
CH ₃
C ₂ H ₅

A	В
Δ ·	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
-(CH	I ₂) ₂ -
-(CH ₂) ₄ -	
-(CH ₂) ₅ -	
-(CH ₂) ₆ -	
-(CH ₂) ₇ -	
-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -	
-(CH ₂) ₂ -S-(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	
-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃ -(CH ₂) ₂ -
(CH ₂) ₂ -CHC	2H ₅ -(CH ₂) ₂ -
-(CH ₂) ₂ -CHC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHi-(C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -
-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOi-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -(CHCH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	

- 25 -

Tabelle 23: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = H$; $V^2 = H$.

Tabelle 24: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = CH_3; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = H; V^2 = H.$$

Tabelle 25: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = H$; $V^1 = 4$ -Cl; $V^2 = H$.

10 Tabelle 26: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = 4-Cl$; $V^2 = H$.

Tabelle 27: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = CH_3; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-Cl; V^2 = H.$$

<u>Tabelle 28:</u> A und B wie in Tabelle 22 angegeben W = H; $X = CH_3$; Z = H; $V^1 = 3$ -Cl; $V^2 = H$.

Tabelle 29: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 3-Cl; V^2 = H.$$

Tabelle 30: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = CH_3$$
; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = 3-Cl$; $V^2 = H$.

25 Tabelle 31: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H, X = CH_3, Z = H, V^1 = 4-CF_3; V^2 = H.$$

Tabelle 32: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-CF_3; V^2 = H.$$

15

- 26 -

Tabelle 33: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = CH_3; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-CF_3; V^2 = H.$$

Tabelle 34: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = H$; $V^1 = 3$ -Cl; $V^2 = 4$ -Cl.

Tabelle 35: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = 3-C1$; $V^2 = 4-C1$.

10 Tabelle 36: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = CH_3$$
; $X = CH_3$; $Z = 4-CH_3$; $V^1 = 3-Cl$; $V^1 = 4-Cl$.

Tabelle 37: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H$$
; $X = CH_3$; $Z = H$; $V^1 = 4$ - CH_3 ; $V^2 = H$.

15

5

Tabelle 38: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-CH_3; V^2 = H.$$

Tabelle 39: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = CH_3; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-CH_3; V^2 = H.$$

Tabelle 40: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H; X = CH_3; Z = H; V^1 = 4-OCH_3; V^2 = H.$$

25 Tabelle 41: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = H; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-OCH_3; V^2 = H.$$

Tabelle 42: A und B wie in Tabelle 22 angegeben
$$W = CH_3; X = CH_3; Z = 4-CH_3; V^1 = 4-OCH_3; V^2 = H.$$

Verwendet man gemäß Verfahren (A) 3-[(2-Methyl-5-phenyl)-phenyl]-5,5-pentamethylen-4-hydroxy- Δ^3 -pyrrolidin-2-on als Ausgangsstoff, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

5

Verwendet man gemäß Verfahren (B) 3-[(2-Methyl-5-(4-chlor)-phenyl)-phenyl]-4-hydroxy-5,5-dimethyl-Δ³-furan-2-on, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

10

Das Verfahren (A) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (II), in welcher A, B, Q, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und eines Halogenierungsmittels und gegebenenfalls eines Radikalstarters umsetzt. Als Radikalstarter können beispielsweise Benzoylperoxid oder Azobisisobutyronitril verwendet werden.

15

20

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (A) alle inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glykoldimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem

halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Dichlorethan, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, aber auch Ester wie Ethylacetat.

Als Halogenierungsmittel kommen für das Verfahren (A) beispielsweise Sulfurylchlorid, Thionylchlorid, Imide wie z.B. N-Bromsuccinimid, N-Chlorsuccinimid, weiterhin Chlorsulfonsäure aber auch Hypochlorite wie z.B. tert.-Butylhypochlorit in Frage.

5

10

15

20

25

30

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -40°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (A) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) setzt man die Reaktionskomponenten der Formel (II) und die Halogenierungsmittel im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 3 Mol) zu verwenden.

Das Verfahren (B) ist dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (II), in welcher A, B, Q, W, X, Y und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines Nitrierungsmittels umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (B) alle inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorbenzol, Dichlorethan.

15

20

25

Als Nitrierungsmittel kommen "Nitriersäuren" bevorzugt rauchende Salpetersäure in Frage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -50°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 80°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (B) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man die Reaktionskomponenten der Formel (II) und das Nitrierungsreagenz im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuss (bis zu 5 Mol) zu verwenden.

Die Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit, günstiger Warmblütertoxizität und guter Umweltverträglichkeit zum Schutz von Pflanzen und Pflanzenorganen, zur Steigerung der Ernteerträge, Verbesserung der Qualität des Erntegutes und zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, in Gärten und Freizeiteinrichtungen, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.

30 Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus carpophagus, Scutigera spp..

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. Scutigerella immaculata.

5 Aus der Ordnung der Thysanura z.B. Lepisma saccharina.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. Onychiurus armatus.

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. Acheta domesticus, Gryllotalpa spp., Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus spp., Schistocerca gregaria.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blattella germanica.

15 Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. Forficula auricularia.

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. Reticulitermes spp..

Aus der Ordnung der Phthiraptera z.B. Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp., Trichodectes spp., Damalinia spp..

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci, Thrips palmi, Frankliniella accidentalis.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp.

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci, Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus ribis, Aphis fabae, Aphis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis,

Phylloxera vastatrix, Pemphigus spp., Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelis bilobatus, Nephotettix

WO 03/045957

. 5

10

15

20

- 31 -

PCT/EP02/12881

cincticeps, Lecanium corni, Saissetia oleae, Laodelphax striatellus, Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii, Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp., Psylla spp.

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimatobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella xylostella, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp., Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Earias insulana, Heliothis spp., Mamestra brassicae, Panolis flammea, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella, Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix viridana, Cnaphalocerus spp., Oulema oryzae.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum, Rhizopertha dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus.

25

30

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp.,

15

20

Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp..

5 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..

Aus der Klasse der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp..

Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp..

Die erfindunsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch als Herbizide und Mikrobizide, beispielsweise als Fungizide, Antimykotika und Bakterizide verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

25 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch

WO 03/045957

- 33 -

PCT/EP02/12881

Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen, Injezieren und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

15

5

10

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

20

25

30

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.

]

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe,

wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

5

10

15

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:

z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Einweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

20

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

25

30

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

10

5

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

15 Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

20

Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

25

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

30

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox,

Guazatin,

10

15

5

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfer-naphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

20

30

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

25 Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon,

Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

Quinconazol, Quintozen (PCNB),

5

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolylfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

Uniconazol,

15 Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

Dagger G,

20

25

OK-8705,

OK-8801,

- α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor-b-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol, α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy-a-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
- α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
- 30 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon, (E)-a-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,

- 38 -

- {2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-1isopropylester
- 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim, 5
 - 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
 - 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
 - 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
 - 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
- 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol, 10
 - 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,
 - 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
 - 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
 - 2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid,
- 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat, 15
 - 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
 - 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
 - 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
 - 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
- 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-ß-D-glycopyranosyl)-a-D-glucopyranosyl]-amino]-4-20 methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
 - 2-Aminobutan,
 - 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
 - 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
- 25 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
 - 2-Phenylphenol(OPP),
 - 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
 - 3,5-Dichlor-N-[cyan](1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
 - 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
- 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin, 30
 - 4-Chlor-2-cyan-N, N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,

i

- 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
- 8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
- 8-Hydroxychinolinsulfat,
- 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
- bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat, cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol, cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholinhydrochlorid,
 - Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
- 10 Kaliumhydrogencarbonat,
 - Methantetrathiol-Natriumsalz,
 - Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
 - Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
 - Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
- N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.
 - N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
 - N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
 - N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
 - N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
- N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 - N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
 - N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
 - N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
 - N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
- 25 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,
 - O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
 - O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioat,
 - S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
 - spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
- 30 4-[3,4-Dimethoxyphenyl)-3-(4-fluorphenyl)-acryloyl]-morpholin

- 40 -

Bakterizide:

5

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acequinocyl, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb,
Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541,
Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

25

20

15

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofol, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Dinetofuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,

- 41 -

Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopfthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethiprole, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,

Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenthion,, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flumethrin, Flupyrazofos, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

10

Granuloseviren

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,

15 Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,

Kempolyederviren

Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

20

Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, Monocrotophos,

25

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A,

Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,

5 Quinalphos,

Ribavirin

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,

10

15

Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon Thetacypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

20 YI 5302

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanyliden)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat

25

- (3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat
- 1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin

30

2-(2-Chlor-6-fluorphenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol

- 2-(Acetlyoxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion
- 2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

- 43 -

- 3-Methylphenyl-propylcarbamat
- 5 4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol
 - 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-3(2H)-pyridazinon
 - 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon
- 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon Bacillus thuringiensis strain EG-2348

Benzoesäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid

- Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-ylester
- 15 [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid
 Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd
 Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat
 N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin
 N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-
- 20 1-carboxamid

N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N"-nitro-guanidin

N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid

N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

- O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat
- 25 N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid
 - 3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-propoxy]-benzol

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit

30 Düngemitteln und Wachstumsregulatoren Safenern bzw. Semiochemicals ist möglich.

WO 03/045957

PCT/EP02/12881

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne dass der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischungen mit Hemmstoffen vorliegen, die einen Abbau des Wirkstoffes nach Anwendung in der Umgebung der Pflanze, auf der Oberfläche von Pflanzenteilen oder in pflanzlichen Geweben vermindern.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

20

5

10

15

Bei der Anwendung gegen Hygiene- und Vorratsschädlinge zeichnet sich der Wirkstoff durch eine hervorragende Residualwirkung auf Holz und Ton sowie durch eine gute Alkalistabilität auf gekälkten Unterlagen aus.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified

5

10

15

20

25

30

- 45 -

Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche

5

10

15

20

25

30

PCT/EP02/12881

Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus Bacillus Thuringiensis (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid

5

10 ·

15

25

30

resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel I bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken nicht nur gegen Pflanzen-, Hygiene- und Vorratsschädlinge, sondern auch auf dem veterinärmedizinischen Sektor gegen tierische Parasiten (Ektoparasiten) wie Schildzecken, Lederzecken, Räudemilben, Laufmilben, Fliegen (stechend und leckend), parasitierende Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge und Flöhe. Zu diesen Parasiten gehören:

Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp..

Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina sowie Ischnocerina z.B. Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp..

Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocerina sowie Brachycerina z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia

spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

5 Aus der Ordnung der Siphonapterida z.B. Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

Aus der Ordnung der Heteropterida z.B. Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

10

30

Aus der Ordnung der Blattarida z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattela germanica, Supella spp...

Aus der Unterklasse der Acari, (Acarina) und den Ordnungen der Meta- sowie Mesostigmata z.B. Argas spp., Ornithodorus spp., Otobius spp., Ixodes spp., 15 Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

20 Aus der Ordnung der Actinedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites 25 spp., Laminosioptes spp..

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und

WO 03/045957

Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermindert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

5

10

15

20

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht im Veterinärsektor in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen (intramuskulär, subcutan, intravenös, intraperitonal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markierungsvorrichtungen usw.

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige Mittel), die die Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

voi voiidon.

Außerdem wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören.

25

Beispielhaft und vorzugsweise - ohne jedoch zu limitieren - seien die folgenden Insekten genannt:

Käfer wie

Hylotrupes bajulus, Chlorophorus pilosis, Anobium punctatum, Xestobium rufovillosum, Ptilinus pecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium

carpini, Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis, Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthes rugicollis, Xyleborus spec. Tryptodendron spec. Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec. Dinoderus minutus.

5

Hautflügler wie

Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus, Urocerus augur.

10 Termiten wie

Kalotermes flavicollis, Cryptotermes brevis, Heterotermes indicola, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastotermes darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptotermes formosanus.

Borstenschwänze wie Lepisma saccharina.

15

25

30

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.

Ganz besonders bevorzugt handelt es sich bei dem vor Insektenbefall zu schützenden Material um Holz und Holzverarbeitungsprodukte.

Unter Holz und Holzverarbeitungsprodukten, welche durch das erfindungsgemäße Mittel bzw. dieses enthaltende Mischungen geschützt werden kann, ist beispielhaft zu verstehen:

Bauholz, Holzbalken, Eisenbahnschwellen, Brückenteile, Bootsstege, Holzfahrzeuge, Kisten, Paletten, Container, Telefonmasten, Holzverkleidungen, Holzfenster und -türen, Sperrholz, Spanplatten, Tischlerarbeiten oder Holzprodukte, die ganz allgemein beim Hausbau oder in der Bautischlerei Verwendung finden.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form von Konzentraten oder allgemein üblichen Formulierungen wie Pulver, Granulate, Lösungen, Suspensionen, Emulsionen oder Pasten angewendet werden.

Die genannten Formulierungen können in an sich bekannter Weise hergestellt werden, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit mindestens einem Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgator, Dispergier- und/oder Binde- oder Fixiermittels, Wasser-Repellent, gegebenenfalls Sikkative und UV-Stabilisatoren und gegebenenfalls Farbstoffen und Pigmenten sowie weiteren Verarbeitungshilfsmitteln.

10

Die zum Schutz von Holz und Holzwerkstoffen verwendeten insektiziden Mittel oder Konzentrate enthalten den erfindungsgemäßen Wirkstoff in einer Konzentration von 0,0001 bis 95 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 60 Gew.-%.

Die Menge der eingesetzten Mittel bzw. Konzentrate ist von der Art und dem Vorkommen der Insekten und von dem Medium abhängig. Die optimale Einsatzmenge kann bei der Anwendung jeweils durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen ist es jedoch ausreichend 0,0001 bis 20 Gew.-%, vorzugsweise 0,001 bis 10 Gew.-%, des Wirkstoffs, bezogen auf das zu schützende Material, einzusetzen.

20

25

30

Als Lösungs- und/oder Verdünnungsmittel dient ein organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein öliges oder ölartiges schwer flüchtiges organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder Wasser und gegebenenfalls einen Emulgator und/oder Netzmittel.

Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder ölartige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und ölartige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle

oder deren Aromatenfraktionen oder mineralölhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

Vorteilhaft gelangen Mineralöle mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Testbenzin mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Spindelöl mit einem Siedebereich von 250 bis 350°C, Petroleum bzw. Aromaten vom Siedebereich von 160 bis 280°C, Terpentinöl und dgl. zum Einsatz.

5

10

25

In einer bevorzugten Ausführungsform werden flüssige aliphatische Kohlenwasserstoffe mit einem Siedebereich von 180 bis 210°C oder hochsiedende Gemische von aromatischen und aliphatischen Kohlenwasserstoffen mit einem Siedebereich von 180 bis 220°C und/oder Spindeöl und/oder Monochlornaphthalin, vorzugsweise α-Monochlornaphthalin, verwendet.

Die organischen schwerflüchtigen öligen oder ölartigen Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, können teilweise durch leicht oder mittelflüchtige organisch-chemische Lösungsmittel ersetzt werden, mit der Maßgabe, dass das Lösungsmittelgemisch ebenfalls eine Verdunstungszahl über 35 und einen Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, aufweist und dass das Insektizid-Fungizid-Gemisch in diesem Lösungsmittelgemisch löslich oder emulgierbar ist.

Nach einer bevorzugten Ausführungsform wird ein Teil des organisch-chemischen Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisches oder ein aliphatisches polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch ersetzt. Vorzugsweise gelangen Hydroxyl- und/oder Ester- und/oder Ethergruppen enthaltende aliphatische organisch-chemische Lösungsmittel wie beispielsweise Glycolether, Ester oder dgl. zur Anwendung.

Als organisch-chemische Bindemittel werden im Rahmen der vorliegenden Erfindung die an sich bekannten wasserverdünnbaren und/oder in den eingesetzten organisch-chemischen Lösungsmitteln löslichen oder dispergier- bzw. emulgierbaren Kunstharze und/oder bindende trocknende Öle, insbesondere Bindemittel bestehend aus oder enthaltend ein Acrylatharz, ein Vinylharz, z.B. Polyvinylacetat, Polyesterharz, Polykondensations- oder Polyadditionsharz, Polyurethanharz, Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz, Phenolharz, Kohlenwasserstoffharz wie Inden-Cumaronharz, Siliconharz, trocknende pflanzliche und/oder trocknende Öle und/oder physikalisch trocknende Bindemittel auf der Basis eines Natur- und/oder Kunstharzes verwendet.

5

10

15

20

25

Das als Bindemittel verwendete Kunstharz kann in Form einer Emulsion, Dispersion oder Lösung, eingesetzt werden. Als Bindemittel können auch Bitumen oder bituminöse Substanzen bis zu 10 Gew.-%, verwendet werden. Zusätzlich können an sich bekannte Farbstoffe, Pigmente, wasserabweisende Mittel, Geruchskorrigentien und Inhibitoren bzw. Korrosionsschutzmittel und dgl. eingesetzt werden.

Bevorzugt ist gemäß der Erfindung als organisch-chemische Bindemittel mindestens ein Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz und/oder ein trocknendes pflanzliches Öl im Mittel oder im Konzentrat enthalten. Bevorzugt werden gemäß der Erfindung Alkydharze mit einem Ölgehalt von mehr als 45 Gew.-%, vorzugsweise 50 bis 68 Gew.-%, verwendet.

Das erwähnte Bindemittel kann ganz oder teilweise durch ein Fixierungsmittel(gemisch) oder ein Weichmacher(gemisch) ersetzt werden. Diese Zusätze sollen einer Verflüchtigung der Wirkstoffe sowie einer Kristallisation bzw. Ausfällem vorbeugen. Vorzugsweise ersetzen sie 0,01 bis 30 % des Bindemittels (bezogen auf 100 % des eingesetzten Bindemittels).

Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributyl-

10

20

25

30

phosphat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Glykolether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

Fixierungsmittel basieren chemisch auf Polyvinylalkylethern wie z.B. Polyvinylmethylether oder Ketonen wie Benzophenon, Ethylenbenzophenon.

Als Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel kommt insbesondere auch Wasser in Frage, gegebenenfalls in Mischung mit einem oder mehreren der oben genannten organisch-chemischen Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgatoren und Dispergatoren.

Ein besonders effektiver Holzschutz wird durch großtechnische Imprägnierverfahren, z.B. Vakuum, Doppelvakuum oder Druckverfahren, erzielt.

Die anwendungsfertigen Mittel können gegebenenfalls noch weitere Insektizide und gegebenenfalls noch ein oder mehrere Fungizide enthalten.

Als zusätzliche Zumischpartner kommen vorzugsweise die in der WO 94/29 268 genannten Insektizide und Fungizide in Frage. Die in diesem Dokument genannten Verbindungen sind ausdrücklicher Bestandteil der vorliegenden Anmeldung.

Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner können Insektizide, wie Chlorpyriphos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Transfluthrin, Thiacloprid, Methoxyphenoxid, Triflumuron, Chlothianidin, Spinosad, Tefluthrin,

sowie Fungizide wie Epoxyconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolylfluanid, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamat, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octylisothiazolin-3-on, sein.

WO 03/045957

- 55 -

PCT/EP02/12881

Zugleich können die erfindungsgemäßen Verbindungen zum Schutz vor Bewuchs von Gegenständen, insbesondere von Schiffskörpern, Sieben, Netzen, Bauwerken, Kaianlagen und Signalanlagen, welche mit See- oder Brackwasser in Verbindung kommen, eingesetzt werden.

5

10

15

20

25

30

Bewuchs durch sessile Oligochaeten, wie Kalkröhrenwürmer sowie durch Muscheln und Arten der Gruppe Ledamorpha (Entenmuscheln), wie verschiedene Lepas- und Scalpellum-Arten, oder durch Arten der Gruppe Balanomorpha (Seepocken), wie Balanus- oder Pollicipes-Species, erhöht den Reibungswiderstand von Schiffen und führt in der Folge durch erhöhten Energieverbrauch und darüber hinaus durch häufige Trockendockaufenthalte zu einer deutlichen Steigerung der Betriebskosten.

Neben dem Bewuchs durch Algen, beispielsweise Ectocarpus sp. und Ceramium sp., kommt insbesondere dem Bewuchs durch sessile Entomostraken-Gruppen, welche unter dem Namen Cirripedia (Rankenflußkrebse) zusammengefaßt werden, besondere Bedeutung zu.

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, eine hervorragende Antifouling (Antibewuchs)-Wirkung aufweisen.

Durch Einsatz von erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, kann auf den Einsatz von Schwermetallen wie z.B. in Bis-(trialkylzinn)-sulfiden, Tri-n-butylzinnlaurat, Tri-n-butylzinnchlorid, Kupfer(I)-oxid, Triethylzinnchlorid, Tri-n-butyl(2-phenyl-4-chlorphenoxy)-zinn, Tributylzinnoxid, Molybdändisulfid, Antimonoxid, polymerem Butyltitanat, Phenyl-(bispyridin)-wismutchlorid, Tri-n-butylzinnfluorid, Manganethylenbisthiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisthiocarbamat, Zink- und Kupfersalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Bisdimethyldithiocarbamat, Kupferthiocyanat, Kupfernaphthenat und Tributylzinnhalogeniden verzichtet werden oder die Konzentration dieser Ver-

bindungen entscheidend reduziert werden.

Die anwendungsfertigen Antifoulingfarben können gegebenenfalls noch andere Wirkstoffe, vorzugsweise Algizide, Fungizide, Herbizide, Molluskizide bzw. andere Antifouling-Wirkstoffe enthalten.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel eignen sich vorzugsweise:

10 Algizide wie

2-tert.-Butylamino-4-cyclopropylamino-6-methylthio-1,3,5-triazin, Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine und Terbutryn;

15

5

Fungizide wie

Benzo[b]thiophencarbonsäurecyclohexylamid-S,S-dioxid, Dichlofluanid, Fluor-folpet, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamat, Tolylfluanid und Azole wie

20

Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propiconazole und Tebuconazole;

Molluskizide wie

25

Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb und Trimethacarb, Fe-chelate;

oder herkömmliche Antifouling-Wirkstoffe wie

4,5-Dichlor-2-octyl-4-isothiazolin-3-on, Diiodmethylparatrylsulfon, 2-(N,N-Dimethylthiocarbamoylthio)-5-nitrothiazyl, Kalium-, Kupfer-, Natrium- und Zinksalze

WO 03/045957

•

PCT/EP02/12881

von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Pyridin-triphenylboran, Tetrabutyldistannoxan, 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin, 2,4,5,6-Tetrachloroisophthalonitril, Tetramethylthiuramdisulfid und 2,4,6-Trichlorphenylmaleinimid.

- 57 -

Die verwendeten Antifouling-Mittel enthalten die erfindungsgemäßen Wirkstoff der erfindungsgemäßen Verbindungen in einer Konzentration von 0,001 bis 50 Gew.-%, insbesondere von 0,01 bis 20 Gew.-%.

Die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel enthalten desweiteren die üblichen Bestandteile wie z.B. in Ungerer, *Chem. Ind.* 1985, 37, 730-732 und Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973 beschrieben.

Antifouling-Anstrichmittel enthalten neben den algiziden, fungiziden, molluskiziden und erfindungsgemäßen insektiziden Wirkstoffen insbesondere Bindemittel.

15

20

Beispiele für anerkannte Bindemittel sind Polyvinylchlorid in einem Lösungsmittelsystem, chlorierter Kautschuk in einem Lösungsmittelsystem, Acrylharze in einem Lösungsmittelsystem insbesondere in einem wäßrigen System, Vinylchlorid/Vinylacetat-Copolymersysteme in Form wäßriger Dispersionen oder in Form von organischen Lösungsmittelsystemen, Butadien/Styrol/Acrylnitril-Kautschuke, trocknende Öle, wie Leinsamenöl, Harzester oder modifizierte Hartharze in Kombination mit Teer oder Biturnina, Asphalt sowie Epoxyverbindungen, geringe Mengen Chlorkautschuk, chloriertes Polypropylen und Vinylharze.

Gegebenenfalls enthalten Anstrichmittel auch anorganische Pigmente, organische Pigmente oder Farbstoffe, welche vorzugsweise in Seewasser unlöslich sind. Ferner können Anstrichmittel Materialien, wie Kolophonium enthalten, um eine gesteuerte Freisetzung der Wirkstoffe zu ermöglichen. Die Anstriche können ferner Weichmacher, die rheologischen Eigenschaften beeinflussende Modifizierungsmittel sowie andere herkömmliche Bestandteile enthalten. Auch in Self-Polishing-Antifouling-Systemen können die erfindungsgemäßen Verbindungen oder die oben genannten

Mischungen eingearbeitet werden.

Die Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam. Zu diesen Schädlingen gehören:

10

15

30

5

Aus der Ordnung der Scorpionidea z.B. Buthus occitanus.

Aus der Ordnung der Acarina z.B. Argas persicus, Argas reflexus, Bryobia ssp., Dermanyssus gallinae, Glyciphagus domesticus, Ornithodorus moubat, Rhipicephalus sanguineus, Trombicula alfreddugesi, Neutrombicula autumnalis, Dermatophagoides pteronissimus, Dermatophagoides forinae.

Aus der Ordnung der Araneae z.B. Aviculariidae, Araneidae.

Aus der Ordnung der Opiliones z.B. Pseudoscorpiones chelifer, Pseudoscorpiones cheiridium, Opiliones phalangium.

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Porcellio scaber.

25 Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus, Polydesmus spp..

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus spp..

Aus der Ordnung der Zygentoma z.B. Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. Blatta orientalies, Blattella germanica, Blattella asahinai, Leucophaea maderae, Panchlora spp., Parcoblatta spp., Periplaneta australasiae, Periplaneta americana, Periplaneta brunnea, Periplaneta fuliginosa, Supella longipalpa.

5

15

20

Aus der Ordnung der Saltatoria z.B. Acheta domesticus.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. Forficula auricularia.

10 Aus der Ordnung der Isoptera z.B. Kalotermes spp., Reticulitermes spp.

Aus der Ordnung der Psocoptera z.B. Lepinatus spp., Liposcelis spp.

Aus der Ordnung der Coloptera z.B. Anthrenus spp., Attagenus spp., Dermestes spp., Latheticus oryzae, Necrobia spp., Ptinus spp., Rhizopertha dominica, Sitophilus granarius, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Stegobium paniceum.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles spp., Calliphora erythrocephala, Chrysozona pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Drosophila spp., Fannia canicularis, Musca domestica, Phlebotomus spp., Sarcophaga carnaria, Simulium spp., Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa.

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Achroia grisella, Galleria mellonella, Plodia interpunctella, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella.

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis.

- 60 -

PCT/EP02/12881

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Camponotus herculeanus, Lasius fuliginosus, Lasius niger, Lasius umbratus, Monomorium pharaonis, Paravespula spp., Tetramorium caespitum.

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Phthirus pubis.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Rhodinus prolixus, Triatoma infestans.

10

WO 03/045957

Die Anwendung im Bereich der Haushaltsinsektizide erfolgt allein oder in Kombination mit anderen geeigneten Wirkstoffen wie Phosphorsäureestern, Carbamaten, Pyrethroiden, Neonicotinoiden, Wachstumsregulatoren oder Wirkstoffen aus anderen bekannten Insektizidklassen.

15

20

25

Die Anwendung erfolgt in Aerosolen, drucklosen Sprühmitteln, z.B. Pump- und Zerstäubersprays, Nebelautomaten, Foggern, Schäumen, Gelen, Verdampferprodukten mit Verdampferplättehen aus Cellulose oder Kunststoff, Flüssigverdampfern, Gelund Membranverdampfern, propellergetriebenen Verdampfern, energielosen bzw. passiven Verdampfungssystemen, Mottenpapieren, Mottensäckehen und Mottengelen, als Granulate oder Stäube, in Streuködern oder Köderstationen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können auch als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

- 61 -

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

<u>Dikotyle Kulturen der Gattungen:</u> Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum,
Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

5

10

15

20

WO 03/045957

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen, sowohl im Vorauflauf- als auch im Nachauflauf-Verfahren.

15

25

30

5

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und pilzlichen oder bakteriellen Pflanzenkrankheiten verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

20 setzen

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven

- 63 -

Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

5

10

15

20

25

30

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospho-

WO 03/045957

- 64 -

PCT/EP02/12881

lipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden und/oder mit Stoffen, welche die Kulturpflanzen-Verträglichkeit verbessern ("Safenern") zur Unkrautbekämpfung verwendet werden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind. Es sind also auch Mischungen mit Unkrautbekämpfungsmitteln möglich, welche ein oder mehrere bekannte Herbizide und einen Safener enthalten.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

20

25

30

5

10

15

Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodium), Ametryne, Amicarbazone, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Beflubutamid, Benazolin(-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon, Benzfendizone, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop (-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butafenacil(-allyl), Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-ethyl), Chlomethoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron (-ethyl), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Cinidon(-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim, Clethodim, Clodinafop (-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron (-methyl), Cloransulam (-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron,

5

10

15

20

25

30

Cycloxydim, Cyhalofop (-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, Desmedipham, Diallate, Dicamba. Dichlorprop (-P), Diclofop (-methyl), Diclosulam, Diethatyl (-ethyl), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop (-P-ethyl), Fentrazamide, Flamprop (-isopropyl, -isopropyl-L, -methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop (-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone (-sodium), Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac (-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen (-ethyl), Flupoxam, Flupropacil, Flurpyrsulfuron (-methyl, -sodium), Flurenol (-butyl), Fluridone, Fluroxypyr (-butoxypropyl, -meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet (-methyl), Fluthiamide, Fomesafen, Foramsulfuron, Glufosinate (-ammonium), Glyphosate (-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop (-ethoxyethyl, -P-methyl), Hexazinone, Imazamethabenz (-methyl), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron (-methyl, -sodium), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapynifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, Mecoprop, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-) Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron (-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Picolinafen, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron (-methyl), Profluazol, Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propoxycarbazone (-sodium), Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-ethyl), Pyrazogyl, Pyrazolate, Pyrazosulfuron (-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyridatol, Pyriftalid, Pyriminobac (-methyl), Pyrithiobac (-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop (-P-ethyl, -P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron (-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbuthylazine, Terbutryn,

PCT/EP02/12881

Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron (-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin, Trifloxysulfuron, Triflusulfuron (-methyl), Tritosulfuron.

5

10

Für die Mischungen kommen weiterhin bekannte Safener in Frage, beispielsweise: AD-67, BAS-145138, Benoxacor, Cloquintocet (-mexyl), Cyometrinil, 2,4-D, DKA-24, Dichlormid, Dymron, Fenclorim, Fenchlorazol (-ethyl), Flurazole, Fluxofenim, Furilazole, Isoxadifen (-ethyl), MCPA, Mecoprop (-P), Mefenpyr (-diethyl), MG-191, Oxabetrinil, PPG-1292, R-29148.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

15

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

25

20.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

15

Ź5

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

- Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.
- Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae,
 Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

20 Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder

Pseudoperonospora cubensis;

30 Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

Bremia-Arten,	wie	beisi	oielsy	veise	Bremia	lactucae
	*****		71 0 101	* OX.		

Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

5 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;

10

Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea

15 (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus

(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

20

Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;

Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;

25 Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;

Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;

30

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;

WO 03/045957

PCT/EP02/12881

- 69 -

Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;

5

Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;

Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;

10 Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;

Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;

15

20

25

30

Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise Pseudocercosporella herpotrichoides.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem
von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender
Inokolation mit unerwünschten Mikroorgansimen weitgehende Resistenz gegen diese
Mirkroorganismen entfalten.

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeit-

- 70 -

raum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

10

15

20

25

30

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise

Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

10

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt: Alternaria, wie Alternaria tenuis,

Aspergillus, wie Aspergillus niger,

15

Chaetomium, wie Chaetomium globosum,

Coniophora, wie Coniophora puetana,

20 Lentinus, wie Lentinus tigrinus,

Penicillium, wie Penicillium glaucum,

Polyporus, wie Polyporus versicolor,

25

Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,

Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,

30 Trichoderma, wie Trichoderma viride,

- 72 -

Escherichia, wie Escherichia coli,

Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,

5 Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

10

15

20

25

30

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

10

5

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

15

20

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

25

30

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

- 74 -

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

5

15

20

25

30

2-Phenylphenol; 8-Hydroxyquinoline sulfate; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarbisopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamine; Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; .10 Carpropamid: Carvone: Chinomethionat; Chlobenthiazone; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolinate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenoconazole; Diflumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap: Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine: Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpicionil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox: Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole: Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid: Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole;

WO 03/045957

- 75 -

Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosinesodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenox; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; 5 Quinconazole; Quinoxyfen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolylfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; 10 Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propynyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-[(methylsulfonyl)amino]-butanamide; 1-(1-naphthalenyl)-1H-pyrrole-2,5-dione; 2,3,5,6-tetrachloro-4-(methylsulfonyl)-pyridine; 2-amino-4-methyl-N-phenyl-5thiazolecarboxamide; 2-chloro-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-15 pyridincarboxam ide; 3,4,5-trichloro-2,6-pyridinedicarbonitrile; Actinovate; cis-1-(4chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazole-1-yl)-cycloheptanol; methyl 1-(2,3-dihydro-2,2dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazole-5-carboxylate; monopotassium carbonate; N-(6-methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropanecarboxamide; N-butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1oxaspiro[4.5]decan-3-amine; Sodium tetrathiocarbonate;

20 sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Copper hydroxide; Copper naphthenate; Copper oxychloride; Copper sulfate; Cufraneb; Cuprous oxide; Mancopper; Oxine-copper.

Bakterizide:

25 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

30 Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,

Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflumet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin,

- Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis strain EG-2348, Bacillus thuringiensis strain GC-91, Bacillus thuringiensis strain NCTC-11821, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-ethyl, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxy-carboxim, Butylpyridaben,
- Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyrifos (-ethyl), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cydia pomonella, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer), Cyromazine,
- DDT, Deltamethrin, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, DOWCO-439,

Eflusilanate. Emamectin. Emamectin-benzoate. Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, Entomopthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,

5 Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenoropathrin, F pyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluarrypyrim, Fluaruron, Flubenzimine, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrazo-10 fos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb,

Gamma-HCH, Gossyplure, Grandlure, Granuloseviren,

Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexy-15 thiazox, Hydramethylnone, Hydroprene,

IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin,

20

30

Japonilure,

Kadethrin, Kempolyederviren, Kinoprene,

25 Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron,

> Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800,

Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Novi-flumuron,

5

10

OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-methyl,

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,

Quinalphos,

Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525,

20

25

30

15

S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121,

Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

- 79 -

Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii,

WL-108477, WL-40027,

5 YI-5201, YI-5301, YI-5302,

XMC, Xylylcarb,

ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901,

10

die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbamat (Tsumacide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO-96/37494, WO-98/25923),

15

20

25

sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sproßpilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes,

- 80 -

Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfaßbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

5 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Versprützen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

10

15

20

25

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele

Beispiel Nr. I-1-1

5

Zu 0,98 g der Verbindung gemäß Beispiel I-1-a-18 (WO 99/48869) in 30 ml absolutem Chloroform werden bei 0 - 5°C 0,24 ml Sulfurylchlorid in 1 ml absolutem Chloroform getropft. Nach 30 min ist die Reaktion beendet (dünnschichtchromatographische Kontrolle).

10

Das Reaktionsgemisch wird mit NaHCO₃-Lösung gewaschen, die organische Phase getrocknet und das Lösungsmittel abdestilliert.

15

Ausbeute: 0,85 g (78 % d. Theorie), Fp. 175°C

Beispiel Nr. I-1-29

- Zu 0,98 g der Verbindung gemäß Beispiel I-1-a-18 (WO 99/48869) in 45 ml absolutem Chloroform werden bei Raumtemperatur 0,33 g (5,2 mmol) rauchende Salpetersäure getropft. Nach 30 min ist die Reaktion beendet (dünnschicht-chromatographische Kontrolle).
- Das Reaktionsgemisch wird zu 40 ml Eiswasser gegeben, die organische Phase wird abgetrennt, die wäßrige Phase mit Dichlormetan extrahiert und die vereinigten organischen Phasen getrocknet. Anschließend wird das Lösungsmittel abdestilliert. Es erfolgt säulenchromatographische Reinigung an Kieselgel (Dichlormethan, Essigsäureethylester, 10:1).

15

Ausbeute: 0,75 g (67 % d. Theorie), Fp. 157°C.

In Analogie zu Beispiel (I-1-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung wurden folgende Verbindungen

der Formel (I-1) erhalten

_	
_	
≟	
9	
ž	

Fp.°C	173	188	. 165	. 281	208				
B	CH ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ (CH ₂) ₂ -	(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ (CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - -CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -	CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - -CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ - -CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - -CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ - -CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ - -(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -CCH ₂) ₂ -CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -CH ₂ -CHOC ₂ H ₃ -(CH ₂) ₂ -(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₃ -(CH ₂) ₂ -(CH ₂)-(CH ₂) ₂ -(CH ₂)-(CH ₂) ₂ -(CH ₂)-(CH ₂)-(CH ₂)-(CH ₂)-(CH ₂)-(C
A	CH ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ -((CH ₂) ₂ -(HO)-	H)-	HD)-	-(CH)-(CH ₂)2-(-(CH ₂) ₂ -(CH ₂)-(CH ₂) ₂ -(CH ₂)-(CH ₂)-(C
9	Ü	IJ	ט	Ü	ס	ם ם	ס ס ס	ס ס ס	
Ω	Н	H	H	Н	H	н	ннн	H H H	H H H H
2	H	H	H	Н	4-CH ₃	4-CH ₃	4-CH ₃	4-CH ₃	4-CH ₃ H H H
Y	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(3-C1-C ₆ H ₄)	4-(3-C1-C ₆ H ₄)	4-(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄) 5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄) 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) 4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄) 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) 4-(4-Cl-C ₆ H ₄) 4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄) 5-(4-Cl-C ₆ H ₄) 4-(4-Cl-C ₆ H ₄) 4-(4-Cl-C ₆ H ₄) 4-(4-Cl-C ₆ H ₄)
×	CI	СН3	СН3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	(H)	CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃
*	н	н	CH ₃	CH ₃	H	Н	Н	H H IJ	CH CH H
BspNr.	I-1-2	I-1-3	I-1-4	I-1-5	I-1-6	I-1-6 I-1-7	I-1-6 I-1-7 I-1-8	I-1-6 I-1-7 I-1-8 I-1-9	I-1-6 I-1-7 I-1-8 I-1-9 I-1-10

-41
⋖
e
_
G
Ω
Lat
_
~
[2
ng]
ung J
Zunz]
etzung]
tsetzung]
rtsetzungʻ
ortsetzung]

			,					,						,				,
Fp°C	228	203	218	222	250	276	223	245	7227	219	227	286	269	255	228	290	289	157
B	H ₃ -(CH ₂) ₂ -	H ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH2)2-	H ₇ -(CH ₂) ₂ -	H ₇ -(CH ₂) ₂ -	H7-(CH2)2	4-	2-	-(CH ₂) ₃ -	-(CH ₂) ₃ -	S	H ₇ -(CH ₂) ₂ -	.5-	I ₃ -(CH ₂) ₂ -	-4-	CH3
V V	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -CHi-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -CHn-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -CHi-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂	-(CH ₂) ₄ -	-(CH ₂) ₂ -	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₂ -CHn-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₅ -	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₄ -	CH ₃
G	ם D	Ü	ರ	CI	CI	CI	CI	CI	CI	CI	CI	C	CI	CI	CI	CI	CI	NO2
Q	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	H	H
Z	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	H.	Н	Н	. H	Н	Н	Н	H	H	H	Н
¥	5-(3-C1-C ₆ H ₄)	5-(3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-CI-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)
×	ū	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Ü	Ü	CH3	CH3	CI	CH ₃	CH3	C	Ü	ū	CH ₃	じ	CH3	CH ₃
¥	н	H	Н	Н	н	Н	Н	Н	H	H	Н	Н	H	н	н	н	H	Н
BspNr.	I-1-12	I-1-13	I-1-14	I-1-15	I-1-16	I-1-17	I-1-18	I-1-19	1-1-20	I-1-21	I-1-22	I-1-23	I-1-24	I-1-25	I-1-26	I-1-27	I-1-28	I-1-29

5

Beispiel I-2-1

Zu einer Lösung von 0,4 g 3-[2-Methyl-5-(4-chlor-phenyl)-phenyl]-5,5-dimethyl-4-hydroxy-Δ³-furan-2-on in 10 ml absolutem Chloroform tropft man unter Eiskühlung eine Lösung von Sulfurylchlorid (0,164 g) in 10 ml absolutem Chloroform und rührt dann 30 min unter Eiskühlung nach.

Dann wird das Reaktionsgemisch mit Wasser, gesättigter Natriumbicarbonatlösung und gesättigter Kochsalzlösung gewaschen und getrocknet.

Ausbeute: 0,4 g (72 % der Theorie), logP (pH 2,5) 4,8.

In Analogie zu Beispiel (I-2-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung wurden folgende Verbindungen

der Formel (I-2) erhalten

(1-2)

2	•
٥	
=	
9	į
-	į

BspNr.	*	×	Y	Z	ပ	¥	В	Fp.°C
1-2-2	н	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	Н	IJ	-(CH ₂) ₂ -CHC	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂	144-146
I-2-3	Н	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	Н	ວ	(CF	-(CH ₂) ₅ -	- 150
I-2-4	н	СН3	5-(3-Cl-C ₆ H ₄)	Н	IJ	-(CH ₂) ₂ -CH ₀	-(CH ₂) ₂ -CHCF ₃ -(CH ₂) ₂ -	108-110
I-2-5	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	Н	CI	i-C ₃ H,	CH3	logP 5.61
I-2-6	Н	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	. 4-CH ₃	CI	TO)-	-(CH ₂) ₄ -	logP 5.56
I-2-7	н	C_2H_5	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Ü	CH3	СН3	logP 5.05
I-2-8	Ħ	CH ₃	5-(4-CN-C ₆ H ₄)	Н	IJ	CH3	СН3	861
I-2-9	Ħ	CH_3	5-(4-CN-C ₆ H ₄)	Н	IJ	-(CI	-(CH ₂) ₄ -	961
I-2-10	Н	СН3	5-(4-F-C ₆ H ₄)	H	וס <u>י</u>	CH3	CH ₃	133-135
I-2-11	Н	CH ₃	5-(3-F-C ₆ H ₄)	Н	ט	CH3	CH ₃	log P 4.30

Fortsetzung Tabelle B

BspNr.	*	×	Ā	2	S	Ą	Я	$\mathbf{F}_{\mathbf{p}}$ °C
I	CH_3	CH3	4-(4-C1-C ₆ H ₄)	Н	IJ	ID)-	-(CH ₂) ₅ -	262
	СН3	C_2H_5	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	Н	IJ	-(СН ₂) ₂ -СНО	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	log P 5.59
	СН3	СН3	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	Н	ご	CH3	CH3	log P 5.11
	CH3	CH_3	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Ü	-(CI	-(CH ₂)4-	152-155
	СН3	СН3	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Ü	-(CH ₂) ₂ -CH	(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	88-58
	CH3	CH3	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	Н	IJ	-CH ₂ -O	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -	log P 4.91
	CH3	CH ₃	4-(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	Ü	-(CH ₂) ₂ -((CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	178-180

logP-Bestimmung bei pH = 2,3

Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

5

15

- (a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.
- 10 (b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.
 - Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenen Alkanonen).
- Die lambda-max-Werte wurde an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Beispiel I-3-1

Zu 0,385 g des Beispiels I-3-a-1 (WO 99/48869) in 10 ml absolutem Chloroform werden unter Eiskühlung 0,10 ml Sulfurylchlorid in 0,5 ml absolutem Chloroform getropft. Es wird 20 min gerührt.

Das Reaktionsgemisch wird mit NaHCO₃-Lösung gewaschen, die organische Phase getrocknet und das Lösungsmittel abdestilliert. Zur weiteren Reinigung wird das Produkt mehrfach mit Cyclohexan/Essigsäureethylester verrührt.

Ausbeute: 0,315 g (75 % d. Theorie), Fp. 157 - 160°C

Tabelle C

In Analogie zu Beispiel (I-3-1) und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung wurden folgende Verbindungen der Formel (I-3) erhalten:

5

$$\begin{array}{c|c}
A & O \\
\hline
 & O \\
\hline$$

BspNr.	W	X	Y	Z	G	A	В	Fp°C
I-3-2	H	CH ₃	5-(4-Cl-C ₆ H ₄)	4-CH ₃	Cl	-(CI	I ₂) ₅ -	Wachs

WO 03/045957

- 91 -

Beispiel A

Myzus-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

5 Emulgator:

2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea), die stark von der Grünen Pfirsichblattlaus (Myzus persicae) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

15

. 10

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit:

Tabelle A pflanzenschädigende Insekten

Myzus persicae -Test

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
Bsp. I-1-1	500	95
Bsp. I-1-14	500	100
Bsp. I-1-6	500	98
Bsp. I-1-7	500	100 .
Bsp. I-1-9	500	95
Bsp. I-1-13	500	100
Bsp. I-1-15	500	95

- 93 -

Beispiel B

Phaedon-Larven-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

5 Emulgator:

2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven des Meerrettichblattkäfers (Phaedon cochleariae) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

15

10

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Käferlarven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Käferlarven abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit:

- 94 -

Tabelle B

pflanzenschädigende Insekten

Phaedon-Larven -Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
Bsp. I-2-1	1000	100
Bsp. I-1-2	500	100
Bsp. I-1-1	500	100
Bsp. I-1-3	500	100
Bsp. I-1-14	500	100
Bsp. I-1-6	500	100
Bsp. I-1-7	500	100
Bsp. I-1-9	500	100
Bsp. I-1-11	500	100
Bsp. I-1-12	500	100
Bsp. I-1-13	500	100
Bsp. I-1-15	500	100
Bsp. I-3-1	500	100

- 95 -

Beispiel C

Plutella-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

5 Emulgator:

2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzen-

10 tration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen der Kohlschabe (Plutella xylostella) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

15

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit:

- 96 -

Tabelle C

pflanzenschädigende Insekten

Plutella-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 ^d
Bsp. I-1-11	500	· 100
Bsp. I-1-12	500	100
Bsp. I-1-13	500	100
Bsp. I-1-15	500	100

5

- 97 -

Beispiel D

Spodoptera exigua-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

5 Emulgator:

2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Kon-

10 zentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen des Heerwurms (Spodoptera exigua) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

15

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wurden.

20 Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit:

- 98 -

Tabelle D

pflanzenschädigende Insekten

Spodoptera exigua-Test

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 ^d
Bsp. I-1-11	500	90
Bsp. I-1-13	500	100
Bsp. I-1-15	500	100

- 99 -

Beispiel E

Spodoptera frugiperda-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

5 Emulgator:

2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration

10 Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen des Heerwurms (Spodoptera frugiperda) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

15

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit:

- 1.00 -

Tabelle E

pflanzenschädigende Insekten

Spodoptera frugiperda-Test

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration	Abtötungsgrad
	in ppm	in % nach 7 ^d
Bsp. I-2-1	1000	100
Bsp. I-1-2	500	100
Bsp. I-1-1	500	100
Bsp. I-1-14	500	100
Bsp. I-1-6	500	100
Bsp. I-1-7	500	100
Bsp. I-1-11	500	100
Bsp. I-1-12	500	100
Bsp. I-1-13	500	100
Bsp. I-1-15	500	100

PCT/EP02/12881

- 101 -

Beispiel F

WO 03/045957

Tetranychus-Test (OP-resistent/Tauchbehandlung)

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

5 Emulgator:

2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzen-

10 tration.

Bohnenpflanzen (Phaseolus vulgaris), die stark von allen Stadien der gemeinen Spinnmilbe (Tetranychus urticae) befallen sind, werden in eine Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration getaucht.

15

Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Spinnmilben abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Spinnmilben abgetötet wurden.

20 Bei diesem Test zeigen z. B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele gute Wirksamkeit:

- 102 -

Tabelle F

pflanzenschädigende Milben

Tetranychus-Test (OP-resistent/Tauchbehandlung)

5

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 ^d
Bsp. I-2-1	100	98
Bsp. I-1-2	100	100 .
Bsp. I-1-1	100	100
Bsp. I-1-14	100	99
Bsp. I-1-6	100	99
Bsp. I-1-7	100	98
Bsp. I-1-8	100	98
Bsp. I-1-11	100	99
Bsp. I-1-12	100	100
Bsp. I-1-13	100	95
Bsp. I-1-15	100	99

- 103 -

Beispiel G

5

10

In vitro-Test zur ED₅₀-Bestimmung bei Mikroorganismen

In die Kavitäten von Mikrotiterplatten wird eine methanolische Lösung des zu prüfenden Wirkstoffs, versetzt mit dem Emulgator PS16, pipettiert. Nachdem das Lösungsmittel abgedampft ist, werden je Kavität 200 µl Potatoe-Dextrose-Medium hinzugefügt.

Das Medium wurde vorher mit einer geeigneten Konzentration von Sporen bzw. Mycel des zu prüfenden Pilzes versetzt.

Die resultierenden Konzentrationen des Wirkstoffs betragen 0,1, 1, 10 und 100 ppm. Die resultierende Konzentration des Emulgators beträgt 300 ppm.

Die Platten werden anschließend 3-5 Tage auf einem Schüttler bei einer Temperatur von 22°C inkubiert, bis in der unbehandelten Kontrolle ein ausreichendes Wachstum feststellbar ist.

Die Auswertung erfolgt photometrisch bei einer Wellenlänge von 620 nm. Aus den Messdaten der verschiedenen Konzentrationen wird die Wirkstoffdosis, die zu einer 50 %igen Hemmung des Pilzwachstums gegenüber der unbehandelten Kontrolle führt (ED₅₀), berechnet.

- 104 -

Tabelle G

In vitro-Test zur ED₅₀-Bestimmung bei Mikroorganismen

Wirkstoff	Mikroorganismus	ED ₅₀ -Wert	
Bsp. I-3-1	Botrytis cinerea	<0,10	
	Pyricularia oryzae	<0,10	
	Septoria tritici	0,61	
	Ustilago avenae	0,27	

- 105 -

Beispiel H

Post-emergence-Test

5 Lösungsmittel:

5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5-15 cm haben so, dass die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, dass in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

20

10

15

Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

- 106 -

Beispiel I

Pre-emergence-Test

5 Lösungsmittel:

10

15

20

5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

1 Gewichtsanteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden mit der Wirkstoffzubereitung bespritzt so, dass die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so ausgewählt, dass in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

25 100 % = totale Vernichtung

- 107 -

pre-emergence/	g ai/ha	Alopecurus	Avena fatu	a Echine	ochloa :	Setaria A	maranthus
Gewächshaus							•
Bsp.l-1-4	250	95	90	1(00	100	90
post-emergence/	g ai/ha	Zuckerrüber	n Alopecu	rus Av	vena fatua	Echinochic	oa Setaria
Gewächshaus							
Bsp. I-1-14	250	0	80		100	100	100
Bsp. I-1-11	250	.0	95		90	100	100
post-emergence / Gewächshaus	g ai/ha	Alopecuru	s Avena fat	ua Ed	chinochloa	Setai	ia
Bsp. I-1-7	250	90	95		100	100	,
Bsp. I-1-9	250	95	100		100	100)
Bsp. I-1-13	250	95	90		100	90	
post-emergence / Gewächshaus	g ai/ha	Zucker- Ale rüben	opecurus	Avena fatua	Digitaria	Echino- chloa	Setaria
Bsp. I-1-2	125	0	90	95	100	100	90
Bsp. I-1-1	125	0	95	100	90	100	100
post-emergence/ Gewächshaus	g ai/ha	Alopecurus	Avena fatua	Echino- chloa	Setaria	a Amarar	nthus Sinapis
Bsp. I-1-6	250	70	100	100	95	70	. •
Bsp. I-1-8	250	95	95	100	100	70	·80
Bsp. I-1-10	250	100	100	100	100	80	80
Bsp. I-1-4	250	100	100	100	100	_	70

- 108 -

Beispiel J

Plasmopara-Test (Rebe) / protektiv

5 Lösungsmittel:

24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator:

1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1

Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von Plasmopara viticola inokuliert und verbleiben dann 1 Tag in einer Inkubationskabine bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit. Anschließend werden die Pflanzen 4 Tage im Gewächshaus bei ca. 21°C und ca. 90 % Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Die Pflanzen werden dann angefeuchtet und 1 Tag in eine Inkubationskabine gestellt.

6 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

15

Tabelle J

Plasmopara-Test (Rebe) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad		
Bsp. I-1-2	100	100		
Bsp. I-1-1	100	100		
Bsp. I-1-14	100	100		
Bsp. I-1-6	100	94		
Bsp. I-1-11	100	100		
Bsp. I-1-12	100	94		
Bsp. I-1-13	. 100	94		

- 110 -

Beispiel K

Venturia-Test (Apfel) / protektiv

5 Lösungsmittel:

24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator:

15

25

1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers Venturia inaequalis inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

- Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.
 - 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

- 111 -

Tabelle K

Venturia-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
Bsp. I-1-2	100	96
Bsp. I-1-1	100	97
Bsp. I-1-6	100	99
Bsp. I-1-11	100	100

- 1.12 -

Beispiel L

Grenzkonzentrations-Test / Bodeninsekten – Behandlung transgener Pflanzen

5 Testinsekt:

Diabrotica balteata - Larven im Boden

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Die Wirkstoffzubereitung wird auf den Boden gegossen. Dabei spielt die Konzentration des Wirkstoffs in der Zubereitung praktisch keine Rolle, entscheidend ist allein die Wirkstoffgewichtsmenge pro Volumeneinheit Boden, welche in ppm (mg/l) angegeben wird. Man füllt den Boden in 0,25 l Töpfe und läßt diese bei 20°C stehen.

20

Sofort nach dem Ansatz werden je Topf 5 vorgekeimte Maiskörner der Sorte YIELD GUARD (Warenzeichen von Monsanto Comp., USA) gelegt. Nach 2 Tagen werden in den behandelten Boden die entsprechenden Testinsekten gesetzt. Nach weiteren 7 Tagen wird der Wirkungsgrad des Wirkstoffs durch Auszählen der aufgelaufenen

25 Maispflanzen bestimmt (1 Pflanze = 20 % Wirkung).

- 113 -

Beispiel M

Heliothis virescens - Test - Behandlung transgener Pflanzen

5 Lösungsmittel:

10

7 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Sojatriebe (Glycine max) der Sorte Roundup Ready (Warenzeichen der Monsanto Comp. USA) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit der Tabakknospenraupe Heliothis virescens besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung der Insekten bestimmt.

WO 03/045957

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel (I),

5

in welcher

Q für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppe N-D steht,

10

X für Halogen, Alkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Nitro, Cyano oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,

15

Y für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Hetaryl steht,

W und Z unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano stehen,

20

A für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls mindestens ein Ringatom durch ein Heteroatom ersetzt ist, oder jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht,

25

B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, oder

- A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten, gegebenenfalls mindestens ein Heteroatom enthaltenden unsubstituierten oder substituierten Cyclus stehen,
- D für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eines oder mehrere Ringglieder durch Heteroatome ersetzt sind, Arylalkyl, Aryl, Hetarylalkyl oder Hetaryl steht oder
 - A und D gemeinsam mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen gesättigten oder ungesättigten und gegebenenfalls mindestens ein Heteroatom enthaltenden, im A,D-Teil unsubstituierten oder substituierten Ring stehen,
 - G für Halogen oder Nitro steht.

10

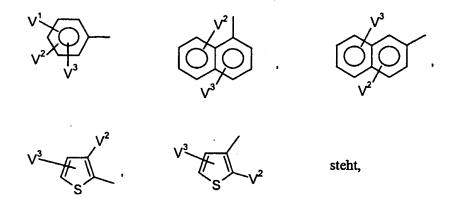
15

25

- 20 2. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 - Q für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppe N-D steht,
 - W für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy steht,
 - X für Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl steht,
 - Y für einen der Reste

15

20



V¹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro, Cyano oder gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl steht,

10 V^2 und V^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkoxy stehen,

Z für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano steht,

A für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₁-C₆-alkyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Ringglieder durch Sauerstoff und/oder Schwefel ersetzt sind oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-

- 117 -

Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl oder für Wasserstoff steht, wenn im Falle der Gruppe (I-1) D ungleich Wasserstoff ist,

- 5 B für Wasserstoff, C₁-C₁₂-Alkyl oder C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl steht oder
- A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₃-C₁₀-Cycloalkyl oder ungesättigtes C₅-C₁₀-Cycloalkyl stehen, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welche gegebenenfalls einfach oder zweifach durch C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkylthio, Halogen oder Phenyl substituiert sind oder
- A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₃-C₆-Cycloalkyl stehen, welches durch eine gegebenenfalls ein oder zwei nicht direkt benachbarte Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthaltende Alkylendiyl-, oder durch eine Alkylendioxyl- oder durch eine Alkylendithioyl-Gruppe substituiert ist, die mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden ist, einen weiteren fünf- bis achtgliedrigen Ring bildet oder
 - A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für C₃-C₈-Cycloalkyl oder C₅-C₈-Cycloalkenyl stehen, in welchen zwei Substituenten gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder Halogen substituiertes C₂-C₆-Alkandiyl, C₂-C₆-Alkendiyl oder C₄-C₆-Alkandiendiyl stehen, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,

- 118 -

D für Wasserstoff, jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, Poly-C₁-C₈-alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₈-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Phenyl steht,

10

15

5

- A und D gemeinsam für jeweils gegebenenfalls substituiertes C₃-C₆-Alkandiyl oder C₃-C₆-Alkendiyl stehen, worin gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und wobei als Substituenten jeweils in Frage kommen:

 C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder eine weitere C₃-C₆-Alkandiylgruppierung,
- G für Chlor, Brom oder Nitro steht.
- 20 3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 - Q für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppe N-D steht,
 - W für Wasserstoff, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkyl steht,

- X für Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder Cyano steht,
- Y für den Rest

10

15

- V¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano, gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl steht,
- V² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy steht,
- Z für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_2 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_2 -Halogenalkoxy steht,
- A für jeweils gegebenenfalls einfach bis fünffach durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Fluor, Chlor, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder jeweils gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder für Wasserstoff steht, wenn im Falle der Gruppe (I-1) D ungleich Wasserstoff ist,
- 25 B für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht, oder
 - A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₃-C₈-Cycloalkyl stehen, worin gegebenenfalls ein Ringglied durch

D

Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls einfach bis zweifach durch C1-C6-Alkyl, C5-C6-Cycloalkyl, C1-C3-Halogenalkyl, C1-C6-Alkoxy, Fluor, Chlor oder Phenyl substituiert ist, mit der Maßgabe, dass D in der Gruppe (I-1) für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl steht,

5

für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls einfach bis fünffach durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl oder C₁-C₄-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, für gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Fluor, Chlor, C1-C4-Alkyl, C1-C₄-Alkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkyl substituiertes C₃-C₇-Cycloalkyl, in welchem gegebenenfalls eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist oder für gegebenenfalls einfach bis zweifach durch Fluor, Chlor, Brom, C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy substituiertes Phenyl steht, oder

10

15

A und D gemeinsam für gegebenenfalls substituiertes C3-C5-Alkandiyl stehen, in welchem eine Methylengruppe durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt sein kann, wobei als Substituenten C₁-C₄-Alkyl in Frage kommen,

20

- für Chlor, Brom oder Nitro steht. G
- Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher 4.

- Q für Sauerstoff, Schwefel oder die Gruppe N-D steht,
- W
- für Wasserstoff, Chlor, Methyl oder Ethyl steht,

15

- X für Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy oder Cyano steht,
- 5 Y für den Rest

$$V^1$$
 steht,

- V¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro oder Cyano steht,
 - V² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy steht,
 - Z für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl oder Methoxy steht,
- A für C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₂-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl,

 in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder

 Schwefel ersetzt ist oder für Wasserstoff steht, wenn im Falle der

 Gruppe (I-1) D ungleich Wasserstoff ist,
 - B für Wasserstoff, Methyl, Ethyl steht oder
 - A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₃-C₈-Cycloalkyl stehen, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls

einfach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, n-Butoxy oder iso-Butoxy substituiert ist, mit der Maßgabe, dass D in der Gruppe (I-1) für Wasserstoff oder C_1 - C_3 -Alkyl steht,

5

D für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

10

- A, D gemeinsam für gegebenenfalls substituiertes C₃-C₄-Alkandiyl stehen, worin gegebenenfalls ein Kohlenstoffatom durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist,
- G für Chlor oder Nitro steht.

15

5.

- Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 - Q für die Gruppe N-D steht,
 - W für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,

20

- X für Chlor, Methyl oder Ethyl steht,
- Y für den Rest

- V¹ für Chlor oder Methyl steht,
- V² für Wasserstoff oder Chlor steht,

- 123 -

		Z	für Wasserstoff oder Methyl steht,
5		A	für Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, s-Butyl, tert. Butyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,
		В	für Methyl steht,
10	·	A,B	und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für gesättigtes C ₃ C ₈ -Cycloalkyl steht, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls ein fach durch Methyl oder im Falle von C ₆ -Cycloalkyl auch durch Ethyl
15			n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, tertButyl, Trifluormethyl Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, n-Butoxy oder iso-Butoxy substituiert ist,
		D	für Wasserstoff steht,
20		G	für Chlor oder Nitro steht.
20	6.	Verbii	ndungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
		Q.	für Sauerstoff steht,
25		w	für Wasserstoff, Chlor oder Methyl steht,
		x	für Chlor, Methyl oder Ethyl steht,

für den Rest

Y

- V¹ für Chlor, Fluor, Cyano oder Methyl steht,
- 5 V² für Wasserstoff oder Chlor steht,
 - Z für Wasserstoff oder Methyl steht,
- A für Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, s-Butyl, tert.
 Butyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,
 - B für Methyl steht oder
- A, B und das Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₃
 C₈-Cycloalkyl steht, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch

 Sauerstoff oder Schwefel ersetzt ist und welches gegebenenfalls

 einfach durch Methyl oder im Falle von C₆-Cycloalkyl auch durch

 Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, tert.-Butyl, Tri
 fluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, n-Butoxy

 oder iso-Butoxy substituiert ist,
 - G für Chlor steht.
 - 7. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 - Q für Schwefel steht,

W für Wasserstoff steht,

- X für Chlor oder Methyl steht,
- Y für den Rest

- Z für Wasserstoff oder Methyl steht,
- A, B und das Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, für gesättigtes C₅
 10 C₆-Cycloalkyl steht, in welchem gegebenenfalls ein Ringglied durch

 Sauerstoff ersetzt ist und welches gegebenenfalls durch Methyl oder

 Methoxy substituiert ist,
 - G für Chlor steht.

- Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch
 dadurch gekennzeichnet, dass man zum Erhalt von
 - A) Verbindungen der Formeln (I-1) bis (I-3)

20

in welcher

25

A, B, Q, W, X, Y und Z, die oben angegebene Bedeutung haben

- 126 -

und

G für Halogen steht,

5 Verbindungen der Formeln (II-1) bis (II-3)

in welcher

10

A, B, Q, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben

mit Halogenierungsmittel in Gegenwart eines Lösungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Radikalstarters umsetzt oder

15

B) Verbindungen der Formeln (I-1) bis (I-3)

20

in welcher

A, B, Q, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben und

- 127 -

G für Nitro steht,

Verbindungen der Formeln (II-1) bis (II-3)

5

in welcher

A, B, Q, W, X, Y und Z die oben angegebene Bedeutung haben

10

mit Nitrierungsreagenzien in Gegenwart eines Lösungsmittels umsetzt.

 Schädlingsbekämpfungsmittel und/oder Herbizide und/oder Fungizide, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1.

15

10. Verfahren zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und/oder unerwünschten Pflanzenbewuchs und/oder Pilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.

- Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und/oder unerwünschtem Pflanzenbewuchs und/oder Pilzen.
- 25 12. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln und/oder Herbiziden und/oder Fungiziden, dadurch gekennzeichnet, dass man

- 128 -

Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln und/oder Herbiziden und/oder Fungiziden.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

PCT/EP 02/12881

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 C07D513/04 C07D CO7D307/60 C07D493/10 CO7D495/10 C07D207/42 C07D277/34 A01N43/08 A01N43/10 A01N43/36 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 CO7D A01N Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included. In the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data, WPI Data, PAJ, EPO-Internal C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT Relevant to claim No. Category * Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages Α JP 2000 086628 A (OHTSUKA CHEMICAL CO. 1-13 LTD., JAPAN) 28 March 2000 (2000-03-28) cited in the application abstract examples WO 96 35664 A (BAYER AG ; LIEB FOLKER (DE); 1-13 Α HAGEMANN HERMANN (DE); WIDDIG ARNO (DE) 14 November 1996 (1996-11-14) abstract claims examples Further documents are listed in the continuation of box C. Patent family members are listed in annex. Special categories of cited documents: "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but 'A' document defining the general state of the art which is not cited to understand the principle or theory underlying the considered to be of particular relevance invention 'E' earlier document but published on or after the international "X" document of particular relevance; the claimed Invention cannot be considered novel or cannot be considered to filing date document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) involve an inventive step when the document is taken alone document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such docu-*O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or ments, such combination being obvious to a person skilled in the art. other means document published prior to the international filling date but *&* document member of the same patent family tater than the priority date claimed Date of the actual completion of the international search Date of mailing of the international search report 05/03/2003 26 February 2003 Name and mailing address of the ISA Authorized officer European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Stix-Malaun, E Fax: (+31-70) 340-3016

INTERNATIONAL SEARCH REPORT Information on patent family members

Internation pplication No PCT/EP 02/12881

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date	
JP 2000086628	A	28-03-2000	NONE			
WO 9635664	A	14-11-1996	DE	19545467 A1	14-11-1996	
#0 300000 ·	••	• • • • • • • • • • • • • • • • • • • •	AU	5762696 A	29-11-1996	
			BR	9608229 A	29-12-1998	
			CA	2220440 A1	14-11-1996	
			DE	59609921 D1	09-01-2003	
			WO	9635664 A1	14-11-1996	
			EP	0825982 A1	04-03-1998	
			JP	11505220 T	18-05-1999	
			US	6380246 B1	30-04-2002	
			US	6316486 B1	13-11-2001	
			ZA	9603633 A	25-11-1996	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internation Aktenzeichen
PCT/EP 02/12881

A. KLASSII IPK 7	TZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES CO7D513/04 CO7D307/60 CO7D493/2 CO7D277/34 A01N43/08 A01N43/1		C07D207/42
Nach der int	ernationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klass	sifikation und der IPK	
	CHIERTE GEBIETE	January erro do a	
	ter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbol	e)	
IPK 7	CO7D A01N		
Backarchier	te aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, sow	veit diese unter die recherchierte	en Gebiete fallen
	r Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Na		rwendete Suchbegriffe)
CHEM A	BS Data, BEILSTEIN Data, WPI Data, Pa	AJ, EPO-Internal	
C. ALS WE	SENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe	der in Betracht kommenden Te	ile Betr. Anspruch Nr.
A	JP 2000 086628 A (OHTSUKA CHEMICA LTD., JAPAN) 28. März 2000 (2000- in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung Beispiele	L CO., 03-28)	1–13
A	WO 96 35664 A (BAYER AG ;LIEB FOL HAGEMANN HERMANN (DE); WIDDIG ARN 14. November 1996 (1996-11-14) Zusammenfassung Ansprüche Beispiele	KER (DE); O (DE)	1-13
	tere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu	X Siehe Anhang Patentia	mille
	ehmen	*T* Snätere Veröffentlichung die	nach dem internationalen Anmeldedatum
'A' Veröffe	entlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert,	oder dem Prioritätsdatum vo	eröffentlicht worden ist und mit der sondern nur zum Verständnis des der
aberr	nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen	Erfindung zugrundeliegende Theorie angegeben ist	en Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden
Anme	idedatum veröffentlicht worden ist ntlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft er- nen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer en im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden	"X" Veröffentlichung von besond kann allein aufgrund dieser erfinderischer Tällokeit beru	lerer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung Veröffentlichung nicht als neu oder auf uhend betrachtet werden Jezer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung
SON 00	der die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie	kann nicht als auf erfinderts	cher Tätigkeit beruhend betrachtet lichung mit einer oder mehreren anderen
'O' Veröfte	entlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht	Veröffentlichungen dieser K diese Verbindung für einen	ategorie in Verbindung gebracht wird und
P Veröffe		*&* Veröffentlichung, die Mitglie	
	Abschlusses der Internationalen Recherche	Absendedatum des interna	ionalen Recherchenberichts
2	6. Februar 2003	05/03/2003	
Name und	Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2	Bevollmächtigter Bedienste	ter .
	NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Stix-Malaun	, E

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internation Aktenzeichen
PCT/EP 02/12881

im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	I	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung	
JP	2000086628	Α	28-03-2000	KEINE		
WO	9635664		14-11-1996	DE	19545467 A1	14-11-1996
				ΑU	5762696 A	29-11-1996
				BR	9608229 A	29-12-1998
				CA	2220440 A1	14-11-1996
				DE	59609921 D1	09-01-2003
	•			WO	9635664 A1	14-11-1996
				EP	0825982 A1	04-03-1998
				JP	11505220 T	18-05-1999
				US	6380246 B1	30-04-2002
				US	6316486 B1	13-11-2001
				ZA	9603633 A	25-11-1996